

## アイファガン点眼液 0.1%

### CTD 第2部 CTD の概要（サマリー）

#### 2.6 非臨床試験の概要文及び概要表

##### 2.6.1 緒言

千寿製薬株式会社

## 2.6.1 緒言

ブリモニジン酒石酸塩は  $\alpha$  アドレナリン受容体の中でも特に  $\alpha_{2A}$  アドレナリン受容体に高い選択性を示す作動薬である。

ブリモニジン酒石酸塩点眼剤は、米国アラガン社において開発された眼圧下降薬であり、ベンザルコニウム塩化物を保存剤とした 0.2%ブリモニジン酒石酸塩点眼剤として 1996 年に米国にて承認された。その後、眼局所の副作用の軽減を目的として、保存剤をベンザルコニウム塩化物から亜塩素酸ナトリウム液（Purite）に変更するとともに、点眼剤の pH を中性へと変更することによってブリモニジンの眼内移行性を向上させた 0.15%ブリモニジン酒石酸塩-Purite 点眼剤を開発し、2001 年に米国にて承認を取得した。更に、0.15%製剤の pH を上げることにより、ブリモニジンの眼内移行性を向上させた 0.1%ブリモニジン酒石酸塩-Purite 点眼剤を開発し、2005 年に米国にて承認を受けた。これまでに、これらの 3 製剤は米国を初めとする約 70 の国と地域で承認・販売されている。

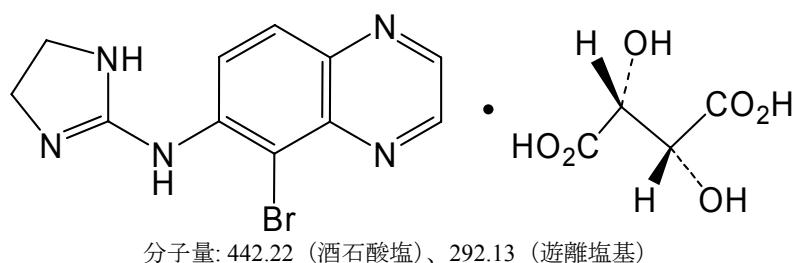


図 2.6.1-1 ブリモニジン酒石酸塩の化学構造式

0.1%ブリモニジン酒石酸塩-Purite 点眼剤は、これまでの眼圧下降薬にない  $\alpha_2$  アドレナリン受容体に対する選択的な作動作用による房水産生の抑制及びぶどう膜強膜流出路からの房水流出の促進という 2 つの機序により眼圧を下降させ、既存の  $\beta$  アドレナリン受容体遮断薬や炭酸脱水酵素阻害薬、プロスタグランジン関連薬との併用における付加的な眼圧下降効果も期待される。更に、臨床使用上問題となる副作用を誘発しないと考えられたことから、ブリモニジン酒石酸塩-Purite 点眼剤は他の眼圧下降薬が効果不十分又は使用できない緑内障及び高眼圧症患者に対する治療のための新たな選択肢になると期待される。

### 【効能・効果】

次の疾患で、他の緑内障治療薬が効果不十分又は使用できない場合：  
緑内障、高眼圧症

### 【用法・用量】

通常、1 回 1 滴、1 日 2 回点眼する。